

QUINAZOLINE DERIVATIVES AS ANGIOGENESIS INHIBITORS

Publication number: WO0047212

Publication date: 2000-08-17

Inventor: HENNEQUIN LAURENT FRANCOIS AND (FR); PLE PATRICK (FR); STOKES ELAINE SOPHIE ELIZABETH (GB); MCKERRECHER DARREN (GB)

Applicant: ASTRAZENECA UK LTD (GB); ZENECA PHARMA SA (FR); HENNEQUIN LAURENT FRANCOIS AND (FR); PLE PATRICK (FR); STOKES ELAINE SOPHIE ELIZABETH (GB); MCKERRECHER DARREN (GB)

Classification:

- international:

A61K31/517; C07D239/88; C07D239/94; C07D401/12; C07D401/14; C07D403/12; C07D403/14; C07D405/12; C07D405/14; C07D413/14; C07D417/12; C07D417/14; C07D471/04; C07D521/00; A61K31/517; C07D239/00; C07D401/00; C07D403/00; C07D405/00; C07D413/00; C07D417/00; C07D471/00; C07D521/00; (IPC1-7): A61K31/505; C07D401/12; C07D401/14; C07D405/12; C07D413/14; C07D417/12

- european:

A61K31/517; C07D239/88; C07D239/94; C07D401/12; C07D401/14; C07D403/12; C07D403/14; C07D405/12; C07D405/14; C07D413/14; C07D417/12; C07D417/14; C07D471/04; C07D521/00B1E2A; C07D521/00B1E3A

Application number: WO2000GB00373 20000208

Priority number(s): EP19990400305 19990210

Also published as:

- US7074800 (B1)
- US2006004017 (A1)
- MXPA01008182 (A)
- EE200100409 (A)
- CN1597667 (A)

[more >>](#)

Cited documents:

- WO9629301
- WO9515758
- EP0602851
- WO9742187
- WO9910349

[more >>](#)

[Report a data error](#) [he](#)

Abstract of WO0047212

The invention relates to the use of compounds of formula (I), wherein ring C is an 8, 9, 10, 12 or 13-membered bicyclic or tricyclic moiety which optionally may contain 1-3 heteroatoms selected independently from O, N and S; Z is -O-, -NH-, -S-, -CH₂- or a direct bond; n is 0-5; m is 0-3; R<2> represents hydrogen, hydroxy, halogeno, cyano, nitro, trifluoromethyl, C1-3alkyl, C1-3alkoxy, C1-3alkylsulphanyl, -NR<3>R<4> (wherein R<3> and R<4>, which may be the same or different, each represents hydrogen or C1-3alkyl), or R<5>X<1>- (wherein X<1> and R<5> are as defined herein; R<1> represents hydrogen, oxo, halogeno, hydroxy, C1-4alkoxy, C1-4alkyl, C1-4alkoxymethyl, C1-4alkanoyl, C1-4haloalkyl, cyano, amino, C2-5alkenyl, C2-5alkynyl, C1-3alkanoyloxy, nitro, C1-4alkanoylamino, C1-4alkoxycarbonyl, C1-4alkylsulphanyl, C1-4alkylsulphinyl, C1-4alkylsulphonyl, carbamoyl, <u>N</u>-C1-4alkylcarbamoyl, <u>N</u>, <u>N</u>-di(C1-4alkyl)carbamoyl, aminosulphonyl, <u>N</u>-C1-4alkylaminosulphonyl, <u>N</u>, <u>N</u>-di(C1-4alkyl)aminosulphonyl, <u>N</u>-(C1-4alkylsulphonyl)amino, <u>N</u>-(C1-4alkylsulphonyl)-<u>N</u>-(C1-4alkyl)amino, <u>N</u>, <u>N</u>-di(C1-4alkylsulphonyl)amino, a C3-7alkylene chain joined to two ring C carbon atoms, C1-4alkanoylaminoC1-4alkyl, carboxy or a group R<56>X<10> (wherein X<10> and R<56> are as defined herein); and salts thereof, in the manufacture of a medicament for use in the production of an antiangiogenic and/or vascular permeability reducing effect in warm-blooded animals, processes for the preparation of such compounds, pharmaceutical compositions containing a compound of formula (I) or a pharmaceutically acceptable salt thereof as active ingredient and compounds of formula (I). The compounds of formula (I) and the pharmaceutically acceptable salts thereof inhibit the effects of VEGF, a property of value in the treatment of a number of disease states including cancer and rheumatoid arthritis.

Data supplied from the esp@cenet database - Worldwide

(19)日本国特許庁 (JP)

(12) 公表特許公報 (A)

(11)特許出願公表番号

特表2002-536414

(P2002-536414A)

(43)公表日 平成14年10月29日 (2002.10.29)

(51) Int.Cl. ⁷	識別記号	F I	テマコード* (参考)
C 07 D 239/88		C 07 D 239/88	4 C 06 3
A 61 K 31/517		A 61 K 31/517	4 C 08 6
31/5377		31/5377	
31/541		31/541	
A 61 P 3/10		A 61 P 3/10	

審査請求 有 予備審査請求 有 (全 520 頁) 最終頁に統く

(21)出願番号	特願2000-598164(P2000-598164)
(86) (22)出願日	平成12年2月8日(2000.2.8)
(85)翻訳文提出日	平成13年8月10日(2001.8.10)
(86)国際出願番号	PCT/GB00/00373
(87)国際公開番号	WO00/47212
(87)国際公開日	平成12年8月17日(2000.8.17)
(31)優先権主張番号	99400305.1
(32)優先日	平成11年2月10日(1999.2.10)
(33)優先権主張国	欧州特許庁 (EP)

(71)出願人	アストラゼネカ アクチボラグ スウェーデン国 151 85 セーデルテル イエ (無番地)
(72)発明者	エネカン, ローラン・フランソワ・アンド レ フランス共和国エフー-51689 ラーンス- セデックス 2, ポワット・ポタル 1050, ゼッド・イ・ラ・ポンペーユ
(72)発明者	ブレ, パトリック フランス共和国エフー-51689 ラーンス- セデックス 2, ポワット・ポタル 1050, ゼッド・イ・ラ・ポンペーユ
(74)代理人	弁理士 社本 一夫 (外5名)
	最終頁に統く

(54)【発明の名称】 血管形成阻害剤としてのキナゾリン誘導体

(57)【要約】

本発明は、式Iの化合物〔式中、環Cは、O、N及びSから独立して選択される1～3個のヘテロ原子を場合により含有し得る8、9、10、12又は13員の二環式又は三環式部分であり；Zは-O-、-NH-、-S-、-CH₂-又は直接の結合であり；nは0～5の整数であり；mは0～3の整数であり；R¹は水素、ヒドロキシ、ハロゲノ、シアノ、ニトロ、トリフルオロメチル、C₁₋₃アルキル、C₁₋₃アルコキシ、C₁₋₃アルキルスルファニル、-NR³R⁴（ここで、R³及びR⁴は同じであっても異なっていてもよく、それぞれ水素又はC₁₋₃アルキルを表す）、又はR⁵X¹-を表し（ここで、X¹及びR⁵は本明細書に定義される通りである）；R¹は水素、オキソ、ハロゲノ、ヒドロキシ、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシメチル、C₁₋₄アルカノイル、C₁₋₄ハロアルキル、シアノ、アミノ、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₁₋₃アルカノイルオキシ、ニトロ、C₁₋₄アルカノイルアミノ、C₁₋₄アルコキシカルボニル、C₁₋₄アルキルスルファニル、C₁₋₄アルキルスルフィニル、C₁₋₄アルキルスルホニル、

カルバモイル、N-C₁₋₄アルキルカルバモイル、N、N-ジ(C₁₋₄アルキル)カルバモイル、アミノスルホニル、N-C₁₋₄アルキルアミノスルホニル、N、N-ジ(C₁₋₄アルキル)アミノスルホニル、N-(C₁₋₄アルキルスルホニル)アミノ、N-(C₁₋₄アルキルスルホニル)-N-(C₁₋₄アルキル)アミノ、N、N-ジ(C₁₋₄アルキルスルホニル)アミノ、環Cの2つの炭素原子に結合したC₈₋₇アルキレン鎖、C₁₋₄アルカノイルアミノC₁₋₄アルキル、カルボキシ、又はR⁶X¹⁰を表す（ここで、X¹⁰及びR⁶は本明細書に定義される通りである）]、及びその塩の、温血動物において抗血管形成効果及び/又は血管透過性抑制効果を生ずるのに使用する医薬品の製造における使用、そのような化合物の製造法、式(I)の化合物又はその製剤的に許容される塩を有効成分として含有する医薬組成物、及び式(I)の化合物群に関する。式(I)の化合物及びその製剤的に許容される塩はVEGFの作用を阻害し、これは癌及び慢性関節リウマチを含む数多くの病態の治療において有用な特性である。